

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平7-247203

(43) 公開日 平成7年(1995)9月26日

(51) Int.Cl. ⁴	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 0 1 N 53/02 53/06 53/08				
		A 0 1 N 53/ 00	5 0 2 C 5 0 6 A	
	審査請求	未請求	請求項の数 3	FD (全 8 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願平6-68060

(22) 出願日 平成6年(1994)3月10日

(71) 出願人 000149181

株式会社大阪製薬

大阪府東大阪市高井田本通3丁目2番4号

(72) 発明者 岡野隆良

兵庫県西宮市新甲町12-32

(74) 代理人 弁理士 山根 賢蔵

(54) 【発明の名称】 ノミ防除剤

(57) 【要約】

【目的】 各種のノミに対しより増強された防除効果を発揮し、比較的に少ない使用量で安全に使用できるノミ防除剤の新規な組成物の提供するにある。

【構成】 d-レスメトリン、フェノトリン、プラレトリン、サイフェノトリン及びベルメトリンの群から選ばれる一又は二以上と、d-アレスリンとの混合によることを特徴とする。

【効果】 この発明による混合剤によれば、ノミ防除効果につき共力作用が得られる。この作用による増強されたノミ防除効果に基づいて、より少量の使用が可能となる安全な使用が可能となる。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 d-レスメトリン、フェノトリン、ブラレトリン、サイフェノトリン及びベルメトリンの群から選ばれる一又は二以上と、d-アレスリンとの混合によってなることを特徴とするノミ防除剤。

【請求項2】 d-レスメトリン、フェノトリン、ブラレトリン、サイフェノトリン及びベルメトリンの群から選ばれる一又は二以上と、d-アレスリンとが、25:75~75:25の範囲の重量比で混合されてなることを特徴とするノミ防除剤。

【請求項3】 分散液中に分散せしめられてなることを特徴とする請求項1又は2のノミ防除剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】この発明は、各種のノミに対し増強された防除（殺虫）効力を有する新規な組成の防除剤に関する。より詳しくは、d-アレスリンのノミ防除効力を増強させ得る組成物を提供するものである。

【0002】

【従来の技術】ノミの成虫は主として哺乳類などの動物に寄生し、その動物の血液を栄養源として生息している。このノミは特に発達した脚をもち、大きく跳ねることによって側近の動物体へも容易に移動することができる。

【0003】近年のペットブームにより、ノミの寄生する動物と人とが接触する機会が多くなったが、ノミの寄生はそれ自体不快であるばかりでなく、多種の病原菌を媒介することもあることから、特に動物体に寄生するノミをより効果的にかつ安全に防除できる薬剤の提供が望まれていた。

【0004】従来のノミ防除剤としては、アレスリン、フタルスリン、ベルメトリン、フェノトリン等のピレスロイド系殺虫剤を主成分とするもの、また混合剤としては、上記の殺虫剤にジエチルトルアミド等の昆虫忌避剤又はピペロニルブトキシサイド等の共力剤を混合配合したものが存在する。

【0005】

【発明が解決しようとする課題】一般に、ノミはハエ、蚊等と比べ殺虫剤に対する感受性は低く、上記したような従来のノミ防除剤では、より多量の薬剤を使用しなければ、ノミに対して十分な防除効果が期待できず、また人畜に対する安全性の面でも問題があった。

【0006】そこで、この発明では、各種のノミに対しより増強された防除効果を発揮し、比較的少ない使用量で安全に使用できるノミ防除剤の新規な組成物の提供を目的とした。

【0007】

【課題を解決するための手段】上記の目的を達成するため、この発明はノミ防除剤につき次のような組成とした。即ち、d-レスメトリン、フェノトリン、ブラレ

トリン、サイフェノトリン及びベルメトリンの群から選ばれる一又は二以上と、d-アレスリンとの混合によってなることを特徴とする。

【0008】上記した組成において、一般名で示した各成分の化学名及び物性は、それぞれ次のとおりである。つまり、d-アレスリンは、アレスロニル d-シス、トランス-クリサンテメート、[澄明な油状液、旋光度 $[\alpha]_D = -1.0 \sim +5.0^\circ$ (0.4g, クロホロホルム, 20ml, 100mm, 20℃)、急性毒性 (ラット経口LD₅₀, mg/kg)=1320(♂)]。

【0009】d-レスメトリンは、5-ベンジル-3-フリルメチル (1R)-シス、トランス-クリサンテメート、[澄明な油状液、旋光度 $[\alpha]_D = -5.0 \sim +1.0^\circ$ (0.4g, クロホロホルム, 20ml, 100mm, 20℃)、急性毒性 (ラット経口LD₅₀, mg/kg)=8800(♂)]。

【0010】フェノトリンは、3-フェノキシベンジル d-シス、トランス-クリサンテメート、[澄明な油状液、比重=1.061(25℃)、蒸気圧= 1.0×10^{-6} mmHg (20℃)、旋光度 $[\alpha]_D = -2.0 \sim +9.0^\circ$ (0.4g, クロホロホルム, 20ml, 100mm, 20℃)、急性毒性 (ラット経口LD₅₀, mg/kg) > 10000/♂]。

【0011】ブラレトリンは、(S)-2-メチル-4-オキソ-3-プロパルギルシクロペンテン-2-エニル (1R)-シス、トランス-クリサンテメート、[澄明な油状液、比重=1.03(20℃)、蒸気圧= 3.5×10^{-5} mmHg (20℃)、急性毒性 (ラット経口LD₅₀, mg/kg)=640(♂)]。

【0012】サイフェノトリンは、(RS)- α -シアノ-フェノキシベンジル (1R)-シス、トランス-クリサンテメート、[油状液、比重=1.085(25℃)、蒸気圧= 9.2×10^{-7} mmHg (20℃)、急性毒性 (ラット経口LD₅₀, mg/kg) = 343 (♂)、370 (♀)]。

【0013】ベルメトリンは、3-フェノキシベンジル dl-シス、トランス-2,2-ジメチル-3-(2,2-ジクロロビニル)シクロプロパン-1-カルボキシレート、[油状液、比重=1.214(25℃)、蒸気圧= 5.5×10^{-7} mmHg (20℃)、急性毒性 (ラット経口LD₅₀, mg/kg)=430(♂)、470(♀)、旋光性なし]。

【0014】また、d-レスメトリン等とd-アレスリンとの種類によっても異なって、任意の割合とすることができるが、d-レスメトリン等とd-アレスリンとを25:75~75:25の範囲の配分割合とすることが好ましい。有効な協力作用がこの範囲において明確に認められるからである。

【0015】また、この発明のノミ防除剤には、他の任意の殺虫剤、昆虫忌避剤、殺菌剤等をこの発明の効果に弊害を生じさせない程度の量で適宜配合することができる。

【0016】また、上記したこの発明は、d-レスメトリン等とd-アレスリンとの混合剤をそのまま利用することができるが、水中に界面活性剤と共に上記混合剤を

乳化分散させた状態で利用することが好ましい。使用時の安全性をより高めることができるからである。

【0017】また、この発明の前記混合剤は、ろ紙、不織布等の保持基材に含浸させた状態で、またカオリン、ペントナイト、タルク等の粉状固体に混合し、またアルコール、灯油等の液体に混合して利用できるほか、ジメチルエーテル等の気体担体に混合し、また塩化ビニル等の樹脂材に練り込んで利用することができる。

【0018】また、具体的には、前記した保持基材及び樹脂材については、敷設部材、構造部材などとして、また前記した粉状固体については、対象物にふりかけ散布し、また液剤であれば、スプレー散布し、それぞれ利用することができる。

【0019】

【作用】この発明の防除剤によれば、各種のノミ（例えば、ネコノミ、イヌノミ、ヒトノミなど）に対し、d-アレスリン単体又はd-レスメトリン、フェノトリン、ブラレトリン、サイフェノトリン若しくはベルメトリン単体で発揮されるノミ防除の相加作用以上の増強された作用である共力作用が生じる。

【0020】（実施例1）d-アスレリンとd-レスメレリン、d-アレスリンとフェノトリン、d-アスレリンとブラレトリン、d-アレスリンとサイフェノトリン、及びd-アレスリンとベルメトリン、を各別に75：25、50：50及び25：75の重量比割合で均一混1液としてそれぞれ調製し、原体試料とした。

【0021】これらの原体試料をそれぞれアセトンで希釈して各種濃度段階の溶液を調製し、これを検体試料とした。この検体試料1mlをメスピペットにとり、100cm²のろ紙（東洋ろ紙NO. 1）上に均等に滴下含浸しこれをシャーレ（直径9cm、高さ6cm）内に敷いた。

【0022】次いで、このろ紙上にネコノミの成虫（羽化後3日目までのもの）を15匹供試昆虫として放ち、これを恒温室（27℃）内に移して処理後24時間後の致死率を観察した。

【0023】上記した試験は前記した各検体試料について、それぞれ1検体につき3回づつ繰り返し、その致死率についての平均値から前記各原体試料についてのLD₅₀値を求めた。このLD₅₀値を次表1に示した。

【表1】

混合剤の成分	成分の 配合割合 (d-アレスリン:X)	LD ₅₀ 値 ($\mu\text{g}/\text{cm}^2$)	連合毒性 係数	評 価
d-アレスリン + d-レスメトリン	100：0	5.50	100	—
	75：25	4.57	122.4	共力作用
	50：50	5.01	113.5	共力作用
	25：75	5.62	103.0	相加作用
	0：100	5.89	100	—
d-アレスリン + フェノトリン	100：0	7.94	100	—
	75：25	7.24	133.9	共力作用
	50：50	6.61	188.4	共力作用
	25：75	12.88	135.1	共力作用
	0：100	28.84	100	—
d-アレスリン + ブラレトリン	100：0	7.32	100	—
	75：25	6.38	116.9	共力作用
	50：50	6.68	115.3	共力作用
	25：75	7.42	106.6	相加作用
	0：100	8.13	100	—
d-アレスリン + サイフェノトリン	100：0	7.33	100	—
	75：25	8.81	99.9	相加作用
	50：50	8.51	129.3	共力作用
	25：75	10.59	139.0	共力作用
	0：100	22.13	100	—
d-アレスリン + ベルメトリン	100：0	7.41	100	—
	75：25	7.59	121.7	共力作用
	50：50	9.66	126.8	共力作用
	25：75	14.96	121.6	共力作用
	0：100	35.48	100	—

なお、表1中、Xは、d-アレスリン、フェノトリン、ブラレトリン、サイフェノトリン及びベルメトリンの群から選択される一つをいう。

【0024】また、上表1には、d-アレスリンの単剤のみ、またd-レスメトリン、フェノトリン、ブラレトリン、サイフェノトリン及びベルメトリンの単剤のみに

よる場合についても前記同様に試験し、そのLD₅₀値を求めて掲示した。

【0025】また、これらのLD₅₀値からサンの方法 (Sun, et al. 1960年) により連合毒性係数を求め、この係数値から連合作用の有無を確認して表1に示した。

【0026】なお、この連合作用は、連合毒性係数が1.00より小さい場合を独立作用、1.00あるいはそれに近い場合を相加作用、1.00よりも著しく大きい場合を共力作用、1.00よりも著しく小さい場合を拮抗作用と評価する。

【0027】サン等の方法とは、具体的には次のとおりである。なお、この方法において、d-アレスリンをA剤とし、またd-レスメトリン、フェノトリン、プラレトリン、サイフェノトリン若しくはベルメトリンのうちのいずれか一つをB剤とし、またA剤とB剤との混合剤をM剤とする。

【0028】先ず、A剤、B剤及びM剤のそれぞれの実

M剤の理論的毒性指数

$$= \left[\begin{array}{l} \text{A剤の実際の毒性指数} \times \text{M剤中のA剤の配合割合} \\ + \text{B剤の実際の毒性指数} \times \text{M剤中のB剤の配合割合} \end{array} \right]$$

【0030】次いで、M剤についてのこの理論的毒性指数と前記の実際の毒性指数とから、連合毒性係数を次式により求める。

【数5】

$$\text{連合毒性係数} = \frac{\text{M剤の実際の毒性指数}}{\text{M剤の理論的毒性指数}} \times 100$$

【0031】この連合毒性係数の値を表1に示したが、その数値の評価から、本発明の混合剤については、いずれも相加作用以上の共力作用が発揮されることを確認することができる。

【0032】(実施例2) d-アレスリンとフェノトリンを、75:25、50:50及び25:75の重量比で混合し、これらを原体試料とした。この原体試料200mgを水(界面活性剤約5重量%含む。)20ml中に混入し、これをそれぞれ検体試料とした。

【0033】これらの検体試料について、それぞれ交互

際の毒性指数を次式により求める。

【数1】

$$\text{A剤の実際の毒性指数} = \frac{\text{A剤のLD}_{50}}{\text{A剤のLD}_{50}} \times 100$$

【数2】

$$\text{B剤の実際の毒性指数} = \frac{\text{A剤のLD}_{50}}{\text{B剤のLD}_{50}} \times 100$$

【数3】

$$\text{M剤の実際の毒性指数} = \frac{\text{A剤のLD}_{50}}{\text{M剤のLD}_{50}} \times 100$$

【0029】次いで、上記のA剤及びB剤の実際の毒性指数からM剤の理論的毒性指数を次式により求める。

【数4】

検定法を適用し、特にこの混合剤についての連合毒性係数を求め、この係数値から連合作用の有無を確認し表3及び図1に示した。

【0034】なお、この連合作用は、連合毒性係数が1.0より小さい場合を独立作用、1.0あるいはそれに近い場合を相加作用、1.0より著しく大きい場合を共力作用、1.0より著しく小さい場合を拮抗作用と評価する。

【0035】また、交互検定法は、具体的には次の処理操作による。つまり、数匹のネコに、ネコ1匹につき、ネコノミ成虫(羽化後3日目までのもの)30匹を寄生させた。このうちの1匹のネコにその身体全体に及ぶように前記の検体試料を体重3~4kgあたり20ml散布した。この散布処理を施してから1日後、2日後及び3日後にノミ取りグシを用いてノミを採取しノミの生存数を数えて次表2に示した。

【表2】

混合剤中の 配合割合 (d-アレスリン： フェノトリン)	ネコ 番号	生存ノミ数 (匹) 駆除率 (%)	インシデント	経過期間			駆除率 平均値
				1日	2日	3日	
100 : 0	A	生存ノミ数	30	30	20	15	45.0
		駆除率	—	0	33.3	50.0	
	B	生存ノミ数	30	23	20	18	
		駆除率	—	23.3	33.3	40.0	
75 : 25	F	生存ノミ数	30	23	19	16	53.4
		駆除率	—	23.3	36.7	46.7	
	G	生存ノミ数	30	23	20	12	
		駆除率	—	23.3	33.3	60.0	
50 : 50	I	生存ノミ数	30	21	15	10	56.7
		駆除率	—	30.0	50.0	66.7	
	J	生存ノミ数	30	30	18	16	
		駆除率	—	0	40.0	46.7	
25 : 75	L	生存ノミ数	30	24	13	10	70.0
		駆除率	—	20.0	56.7	66.7	
	N	生存ノミ数	30	21	10	8	
		駆除率	—	30.0	66.7	73.3	
0 : 100	C	生存ノミ数	30	19	11	10	63.4
		駆除率	—	36.7	63.3	66.7	
	S	生存ノミ数	30	17	13	12	
		駆除率	—	43.3	56.7	60.0	
対照	Q	生存ノミ数	30	30	28	26	—
		—	—	0	6.7	13.3	

この採取ノミについては再度該当するネコに戻した。なお、環境条件は、約24℃、約50%RHであった。

【0036】上記した操作については、対象とするネコを異にして前記した各検体試料についてそれぞれ2回づ

つ行い、1日後、2日後及び3日後の駆除率をそれぞれについて次式により求めて表2に示した。

【数6】

$$\text{駆除率}(\%) = \frac{\text{コントロールの生存数} - \text{試料の生存数}}{\text{コントロールの生存数}} \times 100$$

【0037】この得た駆除率について3日後の値の平均値を求め、その値を次表3に示し、また図1に実測値と

して表した。

【表3】

	(d-アレスリン+フェノトリン) 混合剤 (200mg)				
	100 : 0	75 : 25	50 : 50	25 : 75	0 : 100
配合割合 (d-アレスリン： フェノトリン)					
実測された 駆除率 (%)	45.0	53.4	56.7	70.0	63.4
駆除率の 期待値 (%)	45.0	49.8	54.1	59.0	63.4
連合毒性係数	1.00	1.07	1.05	1.19	1.00
評 価	—	相加作用	相加作用	共力作用	—

【0038】また、d-アレスリンの単剤及びフェノトリンの単剤を前記同様に処理して検体試料とし、この検体試料による駆除率、及び前記同様に3日後の駆除率の

平均値を求めて表2に示した。

【0039】これらの3日後の駆除率の平均値を実際の駆除率としてそれぞれ図1に示し、これらの値を結ぶ直

線を駆除率の期待値特性とし。この特性直線から求めた期待値の数値を表3に示した。この期待値と前記した実測値から次式により連合毒性係数を求めて表3に示し、また図1に表わした。

【数6】

【0040】この得られた連合毒性係数と同理論値との差の範囲を図1に斜線部で示した。この結果から、この実施例の混合剤によれば、少なくとも相加作用以上の効果であって、d-アレスリンとフェノトリンの配合割合が25：75付近においては特に有効な共力作用が発揮され

ることを確認できる。

【0041】（実施例3）d-アレスリンとベルメトリンを、75：25、50：50及び25：75の重量比で混合したものをそれぞれ調製し、これらを原体試料とした。この原体試料 200mgを水（界面活性剤約5重量%を含む。）20 ml中に混入して乳液化し、それぞれ検体試料とした。

【0042】これらの検体試料について、それぞれ交互検定法を適用し、ノミの生存数から前式により1日後、2日後及び3日後の駆除率を求めて次表4に示した。

【表4】

混合剤中の 配合割合 (d-アレスリン： ベルメトリン)	ネ コ 番 号	生存ノミ数 (匹) 駆除率 (%)	仁ジヤル	経過期間			駆除率 平均値
				1日	2日	3日	
100：0	B	生存ノミ数	30	30	21	16	45.0
		駆除率	—	0	30.0	46.7	
	I	生存ノミ数	30	25	20	17	
		駆除率	—	16.7	33.3	43.3	
75：25	F	生存ノミ数	30	25	18	15	53.3
		駆除率	—	16.7	40.0	50.0	
	P	生存ノミ数	30	24	20	13	
		駆除率	—	20.0	33.3	56.7	
50：50	A	生存ノミ数	30	23	14	12	58.3
		駆除率	—	23.3	53.3	60.0	
	O	生存ノミ数	30	28	16	13	
		駆除率	—	6.7	46.7	56.7	
25：75	C	生存ノミ数	30	24	12	8	73.3
		駆除率	—	20.0	60.0	73.3	
	N	生存ノミ数	30	22	8	8	
		駆除率	—	26.7	73.3	73.3	
0：100	S	生存ノミ数	30	16	12	10	65.0
		駆除率	—	46.7	60.0	66.7	
	L	生存ノミ数	30	19	12	11	
		駆除率	—	36.7	60.0	63.3	
対照	Q	生存ノミ数	30	29	26	26	—
		—	—	3.3	13.3	13.3	

この表4の駆除率についての3日後の平均値を次表5に示し、また図2に駆除率の実測値として表した。

【表5】

	(d-アレスリン+ベルメトリン) 混合剤 (200mg)				
配合割合 (d-アレスリン: ベルメトリン)	100 : 0	75 : 25	50 : 50	25 : 75	100 : 0
実測された 駆除率 (%)	45.0	53.3	58.3	73.3	65.0
駆除率の 期待値 (%)	45.0	49.9	54.9	59.9	65.0
連合毒性係数	1.00	1.07	1.06	1.22	1.00
評 価	—	相加作用	相加作用	共力作用	—

【0043】また、d-アレスリンの単剤及びベルメトリンの単剤を前記同様に処理して検体試料とし、この検体試料による駆除率、及び前記同様に3日後の駆除率の平均値を求めて表4に示した。

【0044】これらの3日後の駆除率の平均値を実際の駆除率としてそれぞれ図2に示し、これらの値を結ぶ直線を駆除率の期待値特性とした。この特性直線から求めた期待値の数値を表5に示した。

【0045】この期待値と前記した実測された駆除率とから、前式により連合毒性係数を求めて表5に示し、また図2に表わした。この得られた連合毒性係数と同理論値との差の範囲を図2に斜線部で示した。

【0046】この結果から、本発明の混合剤によれば、少なくとも相加作用以上の効果であって、特に、d-アレスリンとベルメトリンの配合割合が25:75の付近においては有効な共力作用が得られることを確認できる。

【0047】

【発明の効果】 上述のように本発明は構成されるから、次のような効果が発揮される。この発明による混合剤によれば、D-レスメトリン、フェノトリン、プラレトリン、サイフェノトリン又はベルメトリンの単剤でのノミ防除効果以上の共力作用が得られる。

【0048】この増強されたノミ防除効果に基づいて、より少量の使用が可能となってより安全な使用が可能となる。

【図面の簡単な説明】

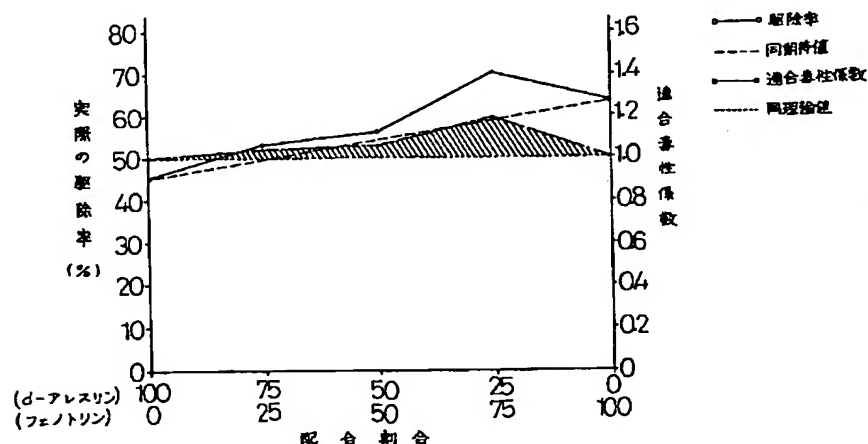
【図1】 実際の駆除率及び連合毒性係数の特性図

【図2】 実際の駆除率及び連合毒性係数の特性図

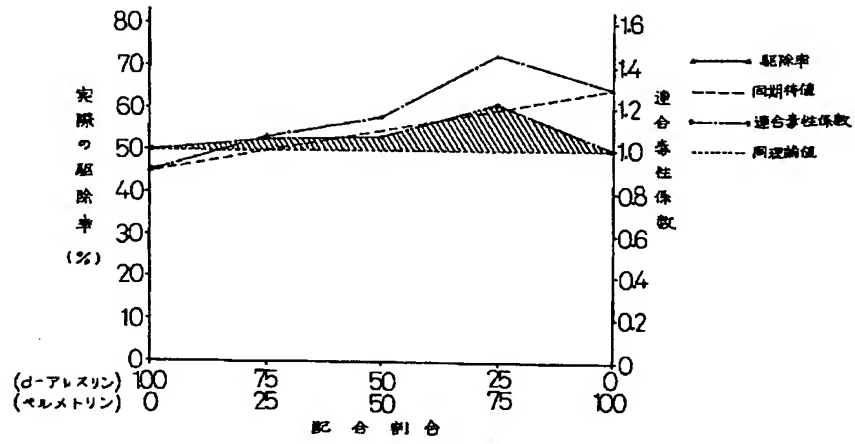
【数7】

$$\text{連合毒性係数} = \frac{\text{実測された駆除率}}{\text{駆除率の理論値}}$$

【図1】



【図2】



フロントページの続き

(51) Int. Cl. ⁶

識別記号

庁内整理番号

F I

A 0 1 N 53/00

技術表示箇所

5 0 8 A

5 0 8 C